REVENDICATIONS MODIFIEES

[Reçues par le Bureau international le 31 mai 2005 (31.05.2005): revendications 1 - 22 remplacées par les revendications 1 - 22.]

1. Composé de formule (III) :

$$R^{-W} \downarrow O \qquad \qquad (CH_2)m - R_3$$

$$R_{-W} \downarrow O \qquad \qquad (III)$$

dans laquelle R₃ représente un groupement choisi parmi :

10

20

25

30

5

- Y représente un atome de soufre ou un groupement -NH-CO-(CH₂)n-X, X représente un atome de soufre S ou un groupement -CH₂-; n est un entier allant de 0 à 10;
- R représente un groupement choisi parmi : les radicaux hydrocarbonés en C₄-C₂₄ ; les radicaux hydrocarbonés fluorés en C₄-C₂₄ ; les radicaux thioalkyls en C₄-C₂₄ ;
 - W représente un groupement -NH- ou CH₂-;
 - p représente un entier allant de 1 à 50;
 - m est un entier allant de 0 à 9 et lorsque X=CH₂ alors 0<m+n<6;
 - x représente un entier allant de 1 à 30;
 - y représente 0 ou un entier allant de 1 à 10;
 - R₁ représente un groupement hydrophile ;
 - R_2 représente un groupement de reconnaissance ayant une affinité pour une cible biologique ;
 - Z est un bras espaceur; Z est lié à R₂ au moyen d'une liaison qui peut être choisie parmi les fonctions -O-CO-, -CO-NH-, -NH-CO-NH-, -NH-CO-O-, O-CO-O-, -O-, -CH=N-, -S- ou par complexation d'un atome de nickel; Z est choisi parmi une chaîne peptidique, un acide Ω-aminé, l'éthanolamine, la 3-propanolamine, une diamine de formule -NH-(CH₂)_{p'}-NH- dans laquelle p' représente un entier allant de 2 à 6, ou -Z-R₂ représente un groupement NTA de formule suivante :

10

15

20

25

2. Composé selon la revendication 1, caractérisé en ce que le groupement R est choisi parmi les radicaux suivants :

le radical thiooctyl

- le n-butyle, le ter-butyle, l'isobutyle, le n-pentyle, l'isopentyle, le n-hexyle, le n-heptyle, le n-octyle, le n-nonyle, le n-décyle, le n-undécyle, le n-dodécyle, le n-tridécyle, le n-tétradécyle, le n-pentadécyle, le n-hexadécyl, le n-heptadécyle, le n-octadécyle, le radical phytyl (CH₃[CH(CH₃)(CH₂)₃]₃CH(CH₃)CH₂CH₂),

les radicaux hydrocarbonés fluorés répondant à la formule $-(CH_2)_t$ - $(CF_2)_r$ F, dans laquelle r et t représentent deux entiers avec : $14 \ge r+t \ge 4$.

3. Composé selon l'une quelconque des revendications 1 et 2, répondant à la formule (I) :

(I)

dans laquelle:

• Y représente un atome de soufre ou un groupement

-NH----(CH₂)n-X-, X étant choisi parmi les groupements S et

CH₂, n est un entier allant de 0 à 10;

- m est un entier allant de 0 à 9 ; et lorsque X=CH₂ alors 0<m+n<6
- W représente un groupement -NH- ou un groupement -CH2-
- p représente un entier allant de 1 à 50
- R₁ représente un groupement choisi parmi les radicaux suivants :

$$\begin{array}{c|c}
H & OR' \\
OR' & OR'
\end{array}$$

FEUILLE MODIFIEE (ARTICLE 19)

10

15

20

dans lesquels R' représente H ou un groupement hydrophile;

• R représente un groupement choisi parmi : les radicaux hydrocarbonés en C₄-C₂₄ ; les radicaux hydrocarbonés fluorés en C₄-C₂₄ ; les radicaux thioalkyls en C₄-C₂₄.

4. Composé selon la revendication 3, caractérisé en ce qu'il répond à la formule (IA) :

dans laquelle:

- X représente un atome de soufre S ou un groupement -CH2-;

- n est un entier allant de 0 à 10;

- m est un entier allant de 0 à 9;

- lorsque X=CH₂ alors 0<m+n<6;

- R représente un groupement choisi parmi : les radicaux hydrocarbonés en C₄-C₂₄ ; les radicaux hydrocarbonés fluorés en C₄-C₂₄ ; les radicaux thioalkyls en C₄-C₂₄.

5. Composé selon la revendication 4, caractérisé en ce que R est choisi de façon à ce que (IA) ait une température de transition de phase supérieure à 37°C.

6. Composé selon la revendication 4 ou la revendication 5, caractérisé en ce qu'il répond à la formule A :

Formule A

7. Composé selon la revendication 6, caractérisé en ce qu'il répond à la formule A1:

FEUILLE MODIFIEE (ARTICLE 19)

10

15

20

8. Composé selon la revendication 3 répondant à la formule (IB) :

dans laquelle:

Y représente un atome de soufre ou le groupement -NH-CO-CH₂CH₂S-

W représente un groupement -NH- ou un groupement -CH₂-

p représente un entier allant de 1 à 50

R₁ représente un groupement choisi parmi les radicaux suivants :

dans lesquels R' représente H ou un composé hydrocarboné polyhydroxylé en C_4 - C_{24} ;

R représente un groupement choisi parmi : les radicaux hydrocarbonés en C_4 - C_{24} ; les radicaux hydrocarbonés fluorés en C_4 - C_{24} ; les radicaux thioalkyls en C_4 - C_{24} .

- 9. Composé selon la revendication 8, caractérisé en ce que R est choisi de façon à ce que (IB) ait une Concentration Micellaire Critique inférieure à 10⁻⁵M.
- 10. Composé selon la revendication 8 ou la revendication 9, caractérisé en ce qu'il vérifie une ou plusieurs des conditions ci-dessous :
 - p représente un entier allant de 1 à 5;
 - Y représente S.

15

20

11. Composé selon l'une quelconque des revendications 8 à 10, caractérisé en ce qu'il répond à la formule C dans laquelle p représente un entier allant de 5 à 15 :

$$\begin{array}{c|c} & & & & \\ & &$$

Composé C

12. Composé selon la revendication 11, caractérisé en ce qu'il répond à la formule C1 :

10 Composé C1

13. Composé selon la revendication 1 ou la revendication 2, caractérisé en ce qu'il répond à la formule (II) :

$$R = \begin{bmatrix} & & & \\ & & &$$

(II)

dans laquelle:

- Y représente un atome de soufre ou le groupement –NH-CO-(CH₂)n-Xdans lequel X représente un atome de soufre S ou un groupement –CH₂-, n est un entier allant de 0 à 10;
 - W représente un groupement -NH- ou -CH2-
 - x représente un nombre entier allant de 1 à 30;

FEUILLE MODIFIEE (ARTICLE 19)

10

- y représente 0 ou un nombre entier allant de 1 à 10 ;
- R1 représente un groupement hydrophile ;
- R₂ représente un groupement de reconnaissance ayant une affinité pour une cible biologique ;
- Z est un bras espaceur ; Z est lié à R_2 au moyen d'une liaison qui peut être choisie parmi les fonctions -O-CO-, -CO-NH-, -NH-CO-NH-, -NH-CO-O-, O-CO-O-, -O-, -CH=N-, -S- ou par complexation d'un atome de nickel ; Z est choisi parmi une chaîne peptidique, un acide Ω -aminé, l'éthanolamine, la 3-propanolamine, une diamine de formule -NH-(CH₂)_{p'}-NH- dans laquelle p' représente un entier allant de 2 à 6, ou -Z-R₂ représente un groupement NTA de formule :

14. Composé selon la revendication 13, caractérisé en ce qu'il répond à la formule (IIA) :

15. Composé selon la revendication 14, caractérisé en ce que l'une ou plusieurs des conditions suivantes sont vérifiées :

$$-X=S$$

- n=2

- R₁ est choisi parmi les radicaux suivants :

dans lesquels R' représente H ou un composé hydrocarboné polyhydroxylé en C₄-C₂₄,

- R est choisi parmi les radicaux suivants :
 - le radical thiooctyl,

15

20

10

20

- le n-butyle, le ter-butyle, l'isobutyle, le n-pentyle, l'isopentyle, le n-hexyle, le n-heptyle, le n-octyle, le n-nonyle, le n-décyle, le n-undécyle, le n-décyle, le n-tétradécyle, radical phytyl (CH₃[CH(CH₃)(CH₂)₃]₃CH(CH₃)CH₂CH₂),
- les radicaux hydrocarbonés fluorés répondant à la formule (CH₂)_t-(CF₂)_rF, dans laquelle r et t représentent deux entiers avec : 14 ≥ r+t ≥ 4.
- R₂ est choisi parmi des anticorps, des fragments d'anticorps, des petites molécules effectrices permettant l'interaction avec des récepteurs de surface cellulaires, des antigènes, des sucres, des peptides.
- 16. Composé selon la revendication 15, caractérisé en ce qu'il répond à la formule F:

Formule F

17. Composé selon la revendication 13, caractérisé en ce qu'il répond à la

15 formule (IIB):

(IIB)

dans laquelle:

- Y représente un atome de soufre ou le groupement -NH-CO-CH₂CH₂S-

18. Nanoparticule caractérisée en ce qu'elle comporte un ou plusieurs composés de formule (l) selon l'une quelconque des revendications 3 à 12 comme constituant de ses parois.

10

- 19. Nanoparticule selon la revendication 18, caractérisé en ce qu'il comporte en outre de 1 à 5% d'un ou plusieurs composés de formule (II) selon l'une quelconque des revendications 13 à 17.
- 20. Nanoparticule selon l'une quelconque des revendications 18 et 19, caractérisé en ce qu'il comporte en outre un télomère ou polymère d'un monomère de type acrylique contenu dans sa cavité aqueuse interne.
- 21. Association d'une nanoparticule selon l'une quelconque des revendications 18 à 20 avec un composé choisi parmi : les principes actifs thérapeutiques, les substances cosmétiques, les agents de diagnostic, les vaccins.
- 22. Composition thérapeutique, de diagnostic, vaccinale ou cosmétique comprenant au moins un principe actif en association avec un liposome selon l'une quelconque des revendications 18 à 20.